

Érvényesség: ~~19800707~~ ~~19840328~~

Bejelentés ügyszám: P8001690  
Közzétételi szám: 30687  
Lajstromszám: 184797  
Elsőbbségi adatok: US055728 - 19790709, US142903 - 19800423  
NSZO: ~~GP701239/90~~

Bejelentés napja: 19800707  
Közzététel napja: 19840328  
Megadás meghirdetése: 19841029

Magyar cím:

Eljárás kinazolin származékok előállítására

Angol cím:

PROCESS FOR PREPARING QUINAZOLINE DERIVATIVES

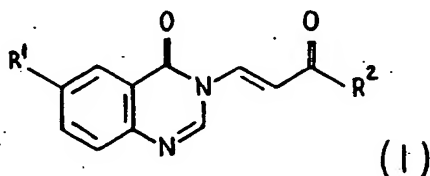
Bejelentő:

F. Hoffmann-La Roche et Co. Ag., Bázél, CH

Feltaláló:

LeMahieu, Ronald Andrew, North, Caldwell, N. J., US

Nason, William Chester, Mountain Lakes, N. J., US



Kivonat:

A találmány tárgya eljárás (I) általános képletű transz-3-(4-oxo-4H-kinazolin-3-il)-propénsav-származékok

(mely képletben

R1 jelentése kis szénatomszámú alkil-, 3-5 szénatomos cikloalkil-, kis szénatomszámú alkoxi- vagy hidroxilcsoport, halogénatom, kis szénatomszámú alkiltio-, kis szénatomszámú alkil-szulfonil-, kis szénatomszámú alkil-szulfonil-csoport, egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O- általános képletű csoport, hidroxil-(kis szénatomszámú)-alkoxi- vagy trifluor-metil-csoport;

R2 jelentése hidroxil-, kis szénatomszámú alkoxi-, egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-O- általános képletű csoport vagy egy di-(C1-4)-alkil-N(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-NH- általános képletű csoport és

n jelentése 2-4-ig terjedő egész szám) és gyógyászati al-kalmas sóik előállítására.

Az (I) általános képletű vegyületeket a megfelelő, a 3-helyzetben helyettesítetlen 4-oxo-4H-kinazolin-származékok és 3-klór-akrilsav-származékok reakciójával állíthatjuk elő.

Az (I) általános képletű új vegyületek a gyógyászatban allergia-ellenes hatásuk révén alkalmazhatók.



- 2 -

**Abstract:**

The present invention relates to a process for the preparation of trans-3-(4-oxo-4H-quinazolin-3-yl)-propenic acid derivatives of the general formula (I) wherein

$R^1$  is lower alkyl,  $C_3$ - $C_5$  cycloalkyl, lower alkoxy, hydroxy, halo, lower alkylthio, lower alkylsulphanyl, lower alkylsulphonyl, a group of the general formula di-( $C_1$ - $C_4$  alkyl)- $N(CH_2)_n-O$ -, hydroxy-(lower alkoxy) or trifluoromethyl;

$R^2$  is hydroxy, lower alkoxy, a group of the general formula di-( $C_1$ - $C_4$  alkyl)- $N(CH_2)_n-O$ - or di-( $C_1$ - $C_4$  alkyl)- $N(CH_2)_n-NH$ -;

$n$  is an integer from 2 to 4

and their pharmaceutically acceptable salts.

The compounds of the general formula (I) can be prepared by reacting a corresponding 3-unsubstituted 4-oxo-4H quinazoline derivative with a 3-chloroacrylic acid derivative.

The compounds of the general formula (I) possess useful antiallergenic activity. "

Enclosed we are also sending you a copy of the abstract attached to the Hungarian search report as well as our Debit Note for the services.

We hope that the above information will be of help to you, however, should you need any additional information, please do not hesitate to contact us.

Very truly yours

  
Zsolt Szentpéteri  
Patent Attorney

Encl.